

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION  
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international



(43) Date de la publication internationale  
6 janvier 2005 (06.01.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale  
WO 2005/000843 A2

(51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup> :  
C07D 417/14

(21) Numéro de la demande internationale :  
PCT/FR2004/001578

(22) Date de dépôt international : 24 juin 2004 (24.06.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :  
03/07648 25 juin 2003 (25.06.2003) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : SO-  
CIE TE DE CONSEILS DE RECHERCHES ET D'AP-  
PLICATIONS SCIENTIFIQUES (S.C.R.A.S.) [FR/FR];  
42, rue du Docteur Blanche, F-75016 Paris (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : GALCERA  
CONTOUR, Marie-Odile [FR/FR]; 2, allée Jacques An-  
quetil, F-91070 Bondoufle (FR). LAVERGNE, Olivier  
[FR/FR]; 9, allée de la Butte de Rheims, F-91120 Palaiseau  
(FR).

(74) Mandataire : BOURGOUIN, André; IPSEN -  
S.C.R.A.S., Direction de la Propriété Industrielle, 24,  
rue Erlanger, F-75781 Paris Cedex 16 (FR).

(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de  
protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO,  
CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB,  
GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG,  
KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG,  
MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH,  
PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN,  
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre  
de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,  
ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),  
européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,  
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI,  
SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,  
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :

— sans rapport de recherche internationale, sera republiée  
dès réception de ce rapport

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abrégia-  
tions, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et  
abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de  
la Gazette du PCT.

(54) Title: BENZOTHIAZOLE-4,7-DIONES AND BENZOXAZOLE-4,7-DIONES WITH SUBSTITUENTS IN POSITION 5 OR  
6 AND METHOD FOR PRODUCTION THEREOF

(54) Titre : BENZOTHIAZOLE-4,7-DIONES ET BENZOXAZOLE-4,7-DIONES SUBSTITUEES EN POSITION 5 OU 6 ET  
LEURS PROCÉDES DE PREPARATION

(57) Abstract: The invention relates to a targetted production method for benzothiazole-4,7-dione and benzoxazole-4,7-dione deriva-  
tives, mono-substituted in the 5 or 6 position with an amino group, itself optionally substituted. Said derivatives are Cdc25 phos-  
phatase inhibitors and may be used for the production of medicaments for the treatment of cancer. Also disclosed are synthetic  
intermediates used in the above production. The invention particularly relates to the following benzothiazole-4,7-dione derivatives:  
2-(2-chloro-6-fluorophenyl)-5-[[2-(dimethylamino)ethyl]amino]-1,3-benzothiazole-4,7-dione and 2-(2-chloro-6-fluorophenyl)-5-  
[(2-pyrrolidin-1-ylethyl)amino]-1,3-benzothiazole-4,7-dione.

(57) Abrégé : L'invention a pour objet un procédé de préparation orienté de dérivés de benzothiazole-4,7-diones et de benzoxa-  
zole-4,7-diones monosubstitués en position 5 ou en position 6 par un groupe amino lui-même éventuellement substitué. Lesdits  
dérivés sont des inhibiteurs des phosphatases Cdc25 et peuvent être utilisés pour préparer des médicaments destinés à traiter le can-  
cer. L'invention offre aussi des intermédiaires de synthèse utiles dans la mise en œuvre du procédé de l'invention. L'invention concerne  
aussi notamment les dérivés de benzothiazole-4,7-diones suivants : 2-(2-chloro-6-fluorophényl)-5-[[2-(diméthylamino)éthyl]amino]-  
1,3-benzothiazole-4,7-dione ; 2-(2-chloro-6-fluorophényl)-5-[[2-(pyrrolidin-1-yléthyl)amino]-1,3-benzothiazole-4,7-dione.

WO 2005/000843 A2